

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
17 février 2005 (17.02.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
**WO 2005/014614 A1**

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> : C07J 61/00,  
A61K 31/56

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/001990

(22) Date de dépôt international : 23 juillet 2004 (23.07.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0309099 25 juillet 2003 (25.07.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : INOVAT  
[TN/TN]; c/o Cabinet Ellouze, Cité Maharajane, Immeuble  
Chiaïra 1, Appt 1-Menzah 1, 1002 Tunis (TN).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : GUTIER-  
REZ, Gilles [FR/FR]; 39, rue Lieutenant Colonel Prévoist,  
F-69006 Lyon (FR). SERRAR, Mostafa [FR/FR]; 81, rue  
du 1er Mars 1943, F-69100 Villeurbanne (FR). HADID,  
Zohra [DZ/FR]; 18, rue Raimu, F-69200 Venissieux (FR).

(74) Mandataire : BURTIN, Jean-François; Gefib, 55, rue  
Aristide Briand, F-92300 Levallois Perret Cedex (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de  
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,

CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,  
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,  
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,  
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,  
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,  
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre  
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,  
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Déclarations en vertu de la règle 4.17 :**

- relative au droit du déposant de demander et d'obtenir un  
brevet (règle 4.17.ii) pour toutes les désignations
- relative au droit du déposant de revendiquer la priorité de  
la demande antérieure (règle 4.17.iii) pour toutes les désignations

**Publiée :**

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des  
revendications, sera republiée si des modifications sont re-  
çues

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abrégia-  
tions, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et  
abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de  
la Gazette du PCT.

(54) Title: STEROID DERIVATIVES AND USE THEREOF AS MEDICAMENTS

(54) Titre : DERIVES DE STEROIDES ET LEUR UTILISATION COMME MEDICAMENTS

(57) Abstract: The invention concerns the field of chemistry and, more particularly, the field of organic chemistry. The invention specifically relates to novel A-nor steroids according to general formula (I) in which R represents hydrogen, a lower alkyl radical having 1 to 7 carbon atoms, a lower cycloalkyl radical having 3 to 7 carbon atoms, an aryl radical having 5 to 10 carbon atoms, an arylalkyl radical in which the alkyl group has 1 to 6 carbon atoms, or an acyl radical derived from an aliphatic carboxylic acid, from a cycloalkyl carboxylic acid or from an aryl carboxylic acid. The invention also relates to pharmaceutical compositions containing, as an active substance, at least one compound of general formula (I) in association or mixed with an excipient or an appropriate vehicle. The inventive pharmaceutical compositions can also contain another active substance that having a similar or synergetic action. The compounds of general formula (I) are used as medicaments that aid in fixing calcium by osteoblasts.

(57) Abrégé : La présente invention se rapporte au domaine de la chimie et plus particulièrement à celui de la chimie organique. Elle a spécifiquement pour objet de nouveaux A-nor stéroïdes répondant à la formule générale (I) dans laquelle R est de l'hydrogène, un radical alcoyle inférieur ayant de 1 à 7 atomes de carbone, un radical cycloalcoyle inférieur ayant de 3 à 7 atomes de carbone, un radical aryle ayant de 5 à 10 atomes de carbone, un radical arylalcoyle où le groupe alcoyle a de 1 à 6 atomes de carbone, ou un radical acyle dérivé d'un acide aliphatique carboxylique, d'un acide cycloalcoylcarboxylique ou d'un acide arylcarboxylique. L'invention a encore pour objet les compositions pharmaceutiques renfermant, à titre de principe actif, au moins un composé de la formule générale (I) en association ou en mélange avec un excipient ou un véhicule approprié. Les compositions pharmaceutiques selon l'invention peuvent en outre contenir un autre principe actif d'action similaire ou synergique. Utilisation des composés de formule générale (I) comme médicaments pour favoriser la fixation du calcium par les ostéoblastes.

WO 2005/014614 A1